

**Cosmetic preparation for treating light-induced skin ageing.**

Patent Number: EP0579079

Publication date: 1994-01-19

Inventor(s): VOSS ECKART DR (DE); FINKEL PETER DIPL-ING (DE)

Applicant(s):: BAYER AG (DE)

Requested  
Patent: ☐ EP0579079, B1Application  
Number: EP19930110701 19930705Priority Number  
(s): DE19924223463 19920716

IPC Classification: A61K7/42

EC Classification: A61K7/42, A61K7/48C4D2, A61K7/48C26D6

Equivalents: AU4164493, ☐ BR9302884, CA2100405, ☐ DE4223463, ES2099322T, GR3022810T, HU64687,  
☐ JP6157265, MX9304117, ZA9305104

---

**Abstract**

---

The present invention relates to a cosmetic preparation for external use based on substances which absorb UV radiation in combination with a radical scavenger system.

Data supplied from the esp@cenet database - I2

19



Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets



11 Veröffentlichungsnummer: **0 579 079 A1**

12

## EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

21 Anmeldenummer: **93110701.5**

51 Int. Cl.<sup>5</sup>: **A61K 7/42**

22 Anmeldetag: **05.07.93**

30 Priorität: **16.07.92 DE 4223463**

71 Anmelder: **BAYER AG**

43 Veröffentlichungstag der Anmeldung:  
**19.01.94 Patentblatt 94/03**

**D-51368 Leverkusen(DE)**

84 Benannte Vertragsstaaten:  
**AT BE CH DE DK ES FR GB GR IT LI NL PT SE**

72 Erfinder: **Voss, Eckart, Dr.**  
**Johann-Janssen-Strasse 88**  
**D-51375 Leverkusen(DE)**  
Erfinder: **Finkel, Peter, Dipl.-Ing.**  
**Isidor-Caro-Strasse 56**  
**D-51061 Köln(DE)**

54 **Kosmetisches Pflegemittel gegen lichtbedingte Hautalterung.**

57 Die vorliegende Erfindung betrifft ein neues kosmetisches Pflegepräparat zur äußeren Anwendung auf der Basis von UV-Strahlung absorbierenden Substanzen in Kombination mit einem Radikalfängersystem.

**EP 0 579 079 A1**

0,3 bis 8 % Vitamin-E-linoleat und/oder Vitamin-E-acetat und  
 0,3 bis 5 % 2-(Dihydroxyethyl)-2-hydroxy-6,10,14-trimethyl-pentadecan sowie gegebenenfalls  
 0,3 bis 10 % eines oder mehrerer UV-Filterstoffe.

Die oben aufgeführten kosmetischen Pflegemittel enthalten vorzugsweise wenigstens einen UV-Filter-  
 5 stoff in den angegebenen Konzentrationsbereichen.

Als UV-Filterstoffe kommen vorzugsweise alle in der EG-Positivliste genannten UV-absorbierenden  
 Verbindungen infrage, die in der vierzehnten Richtlinie 92/8/EWG der Kommission vom 18. Febr. 1992  
 veröffentlicht sind.

Dies sind im allgemeinen Benzylidenkampferverbindungen, p-Aminobenzoessäure sowie ihre Derivate,  
 10 Cinnamate, Benzoxazol-Derivate; Benzophenonderivate und Benzotriazol-Derivate.

Bevorzugt werden als UV-Filter die folgenden Verbindungen eingesetzt:

N-Propoxylierter 4-Aminobenzoessäure-ethylester (Mischung von Isomeren)

Ethoxilierter 4-Aminobenzoessäure-ethylester

4-Aminobenzoessäure-glycerylester

15 2-Ethylhexyl-4-dimethylaminobenzoat

2-Ethylhexylsalicyclat

4-Methoxizimtsäure-isopentylester (Mischung von Isomeren)

2-Ethylhexyl-4-methoxycinnamat

2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methyl-benzophenon [Mexenon (INN)]

20 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfosäure und Natriumsalz (Sulisobenzon und Natriumsalz)

$\alpha$ -(2-Oxoborn-3-yliden-toluen)-4-Sulfonsäure und ihre Salze

3-(4'-Methylbenzyliden)-d,1-Campfer

3-Benzylidencampfer

4-Isopropyl-dibenzoylmethan

25 4-Isopropylbenzylsalicyclat

1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphenyl)propan-1,3-dion

2,4,6-Triänilin-(p-carbo-2'-ethylhexyl-1'-oxi)-1,3,5-triazin.

Besonders bevorzugt verwendet man als UV-Filter die folgenden Verbindungen:

2-Ethoxyhexyl-p-(dimethylamino)-benzoat;

30 2-Ethylhexyl-p-methoxycinnamat;

3-(4'-Methylbenzyliden)-d,1-kampfer;

2-Hydroxy-5-methoxybenzophenon;

2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure;

2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure.

35 Das erfindungsgemäße kosmetische Mittel enthält neben der o.a. Wirkstoffkombination üblicherweise in  
 kosmetischen Mitteln eingesetzte Grund- und Hilfsstoffe, insbesondere Stabilisatoren und Antioxidantien wie  
 Butylhydroxyanisol, Butylhydroxytoluol, EDTA Salze wie Magnesiumsulfat in Mengen von 0,02 bis 5 % u.a.

Zu den Grund- und Hilfsstoffen zählen desweiteren in der Kosmetik übliche Lösungsmittel wie Wasser  
 bis zu 80 %, Monoalkohole, niedrige Polyalkohole mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder Mischungen davon,  
 40 weiterhin Fettkörper, wie mineralische, tierische, oder pflanzliche Öle wie Paraffinöl oder Wachse wie  
 Mikrowachs, Fettsäuren, Fettalkohole, Fettsäureester wie Cetylstearylisononanoat und Isopropylpalmitat,  
 Fettalkoholether, oxethylierte Fettalkohole, Lanolin und Derivate sowie Silikonöle in Mengen von 0,5 bis 50  
 %, vorzugsweise 0,5 bis 30 %, besonders bevorzugt in Mengen von 5 bis 30 %.

Das erfindungsgemäße kosmetische Pflegemittel enthält gegebenenfalls Emulgatoren in Mengen von  
 45 0,1 bis 20 %, bevorzugt in Mengen von 0,2 bis 10 %, wobei es sich um in der Kosmetik üblicherweise  
 verwendete Emulgatoren, insbesondere um nichtionische, anionische, kationische oder amphotere Verbin-  
 dungen handelt, z.B. Sterole, Polyol-Fettsäureester und -Fettalkoholether, Alkali- und Triethanolaminsalze  
 von Fettsäuren, Natriumcetylstearylsulfat, Tetracylammoniumhalogenide, Phospholipide. Beispiele hierfür  
 sind Glycerinsorbitanfettsäureester, Polyoxyethylenfettsäureester, Alkyltetraglykolether-o-phosphorsäuree-  
 50 ster.

Ferner können 0,02 bis 5 %, bevorzugt 0,1 bis 2 % Verdickungsmittel und Vergelungsmittel im  
 erfindungsgemäßen Mittel eingesetzt sein. Dazu zählen Polyacrylsäurederivate, Cellulosederivate, Bentonite,  
 Xanthanderivate, Alginate, Guarmehl und Johannisbrotmehl. Beispiele sind Polyacrylsäureamid und  
 Zinkstearat.

55 Das erfindungsgemäße Präparat kann weitere in kosmetischen Mitteln übliche Stoffe enthalten. Dazu  
 zählen Feuchthaltemittel (0,5 bis 15 %), Farbstoffe, Puffersubstanzen, Konservierungsmittel und Parfümöle  
 in Mengen von 0,01 bis 5,0 %.

Als Feuchthaltemittel seien beispielhaft aufgeführt: Niedrige Polyalkohole wie Glycerin, Propylenglykol, Butylenglykol, Sorbitol, desweiteren die 2-Pyrrolidon-5-carbonsäure und ihr Natriumsalz, Milchsäure und ihre Salze, Harnstoff, Proteine und Proteinderivate wie Collagen, desweiteren Hyaluronsäure u.a.

Als den erfindungsgemäßen kosmetischen Präparaten zuzusetzende Farbstoffe seien beispielhaft aufgeführt:

Farbe C.I. 16255, Farbe C.I. 61570, Farbe C.I. 42051, Farbe C.I. 15985, Farbe C.I. 77492.

Als Konservierungsmittel kommen vorzugsweise in Frage:

2,4-Hexadiensäure (Sorbinsäure und ihre Salze),

4-Hydroxybenzoesäure, ihre Salze und Ester,

3-Acetyl-6-methyl-2,4(3H)-pyrandion (Dehydracetsäure) und seine Salze,

1,1-Methylen-bis-(3-(1-hydroxymethyl-2,4-dioximidazolidin-5-yl)-harnstoff),

Imidazolidinylharnstoff,

2-Phenoxy-ethanol,

Benzylalkohol.

Das erfindungsgemäße kosmetische Hautpflegemittel liegt vorzugsweise als Emulsion (Creme oder Milch) vor, wobei es sich um Öl-in-Wasser- oder Wasser-in-Öl-Emulsionen handeln kann. Die Darstellung erfolgt im allgemeinen durch Mischen und Rühren der Komponenten, gegebenenfalls mit anschließendem Homogenisieren, gegebenenfalls und vorzugsweise in einer evakuierten Apparatur.

Alle Prozentangaben im vorliegenden Text beziehen sich auf Gewichtsprozente, wenn nichts anderes angegeben ist.

Die Erfindung wird im folgenden anhand der Beispiele näher erläutert, ohne daß dies einschränkenden Charakter haben soll.

#### Beispiel 1a

25

Öl-in-Wasser-Emulsion (pflegende Creme)			(Angabe in g)
30	I.	Polysorbate 60	1,5
		Sorbitanstearate	(Emulgator) 0,9
		Octyldodecanol	10,0
		Cetearyl Alkohol	(Fettkomponenten) 6,0
	II.	Polyacrylsäureamid	(Verdicker) 0,6
35	III.	Vitamin-E-linoleate	5,0
		2-(Dihydroxyethyl)-2-hydroxy-6,10,14-trimethyl-pentadecan	2,0
	IV.	Parfümöl	0,3
		Konservierungsmittel	q.s.*
40	V.	Glycerin	(Feuchthaltemittel) 5,0
		Wasser	ad 100,0

\*) q.s. = quantum satifans, d.h. die in Abhängigkeit vom jeweiligen Konservierungsmittel einzusetzende bzw. ausreichende Menge

45

#### Beispiel 1b

Zusammensetzung wie in Beispiel 1a jedoch zusätzlich 2,0 g p-Methoxyzimtsäure-ethylester als UV-B-Filer bei 66,1 g Wassergehalt.

Herstellung der Beispiele 1a und 1b:

Die Mischung 1 wird bei 75°C zum Schmelzen gebracht, II eindispersiert und der auf die gleiche Temperatur erwärmten Lösung V zugesetzt. Unter weiterem Rühren und Homogenisieren läßt man auf 35°C abkühlen, dann gibt man die Mischung III und IV hinzu, ergänzt mit Wasser auf 100 g und läßt unter weiterem Rühren auf Raumtemperatur abkühlen. Die gesamte Herstellung erfolgt in einer evakuierten Apparatur, um das Einarbeiten von Luft zu vermeiden.

Beispiel 2a

5	Öl-in-Wasser-Emulsion (Pflegelotion)			(Angabe in g)
	I.	Trilaureth-4-phosphate	(Emulgator)	1,0
		Paraffinöl dünnflüssig	(Fettsäure-komponenten)	10,0
		Isopropylpalmitat		5,0
10	II.	Polyacrylsäureamid	(Verdicker)	0,8
	III.	Vitamin-E-linoleate		0,5
		2-(Dihydroxyethyl)-2-hydroxy-6,10,14-trimethyl-pentadecan		0,5
15	IV.	Parfümöl		0,3
		Konservierungsmittel		q.s.
	V.	Glycerin	(Feuchthaltemittel)	5,0
		Saccharide Isomerase		3,0
20		Wasser		ad 100,0

Beispiel 2b

25

Zusammensetzung wie Beispiel 2a, jedoch zusätzlich 2,0 g UV-B-Filter bei 71,3 g Wassergehalt.

Herstellung der Beispiele 2a und 2b:

30 Die Mischung I wird bei 75 °C zum Schmelzen gebracht, II eindispersiert und der auf die gleiche Temperatur erwärmten Lösung V zugesetzt. Unter weiterem Rühren und Homogenisieren läßt man auf 35 °C abkühlen, dann gibt man die Mischung III und IV hinzu, ergänzt mit Wasser auf 100 g und läßt unter weiterem Rühren auf Raumtemperatur abkühlen. Die gesamte Herstellung erfolgt in einer evakuierten Apparatur, um das Einarbeiten von Luft zu vermeiden.

35

Beispiel 3a

40	Wasser-in-Öl-Emulsion (Pflegecreme)			(Angaben in g)
	I.	Cetyl Dimethicone Copoliol (und) Cetyldimethicon (und) Polyglyceryl-3-oleat (und) Hexyllaurat	(Emulgator)	5,0
		Isohexadecan	(Fett-kompo-nenten)	8,0
45		Caprylic/Capric Triglyceride		8,0
		Mikrowachs		5,0
		p-Methoxyzimtsäureethylester	(UV-B-Filter)	2,0
	II.	Vitamin-E-linoleat		2,0
50		2-(Dihydroxyethyl)-2-hydroxy-6,10,14-trimethyl-pe- ntadecan		1,0
	III.	Parfümöl		0,5
		Konservierungsmittel		q.s.
55	IV.	Glycerin	(Feuchthaltemittel)	3,0
		Natriumchlorid	(Stabilisator)	1,5
		Wasser		ad 100,0

Beispiel 3b

Zusammensetzung wie Beispiel 3a, jedoch ohne UV-B-Filter bei 65,4 g Wassergehalt.

5 Herstellung der Beispiele 3a und 3b:

Die Mischung I wird bei 75 °C zum Schmelzen gebracht und die auf die gleiche Temperatur erwärmte Lösung IV unter Rühren zugegeben. Unter weiterem Rühren und Homogenisieren läßt man auf 35 °C abkühlen, dann gibt man die Mischung II und III hinzu, ergänzt mit Wasser auf 100 g und läßt unter  
10 weiterem Rühren auf Raumtemperatur abkühlen. Die gesamte Herstellung erfolgt in einer evakuierten Apparatur, um das Einarbeiten von Luft zu vermeiden.

**Patentansprüche**

- 15 1. Kosmetisches Hautpflegemittel, dadurch gekennzeichnet, daß es neben üblichen Grund- und Hilfsstoffen eine Kombination aus Vitamin-E oder seinen Derivaten und 2-(Dihydroxyethyl)-2-hydroxy-6,10,14-trimethyl-pentadecan sowie gegebenenfalls wenigstens einen UV-Filterstoff enthält.
2. Kosmetisches Hautpflegemittel gemäß dem Anspruch 1, welches Vitamin-E-linoleat und/oder Vitamin-E-acetat enthält.
- 20 3. Kosmetisches Hautpflegemittel in Emulsionsform gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß es neben üblichen Grund- und Hilfsstoffen eine Kombination aus  
0,1 bis 20 % (Gew.-%) eines oder mehrerer UV-Filterstoffe,  
25 0,1 bis 10 % (Gew.-%) Vitamin-E-linoleat und/oder Vitamin-E-acetat und  
0,1 bis 10 % (Gew.-%) 2-(Dihydroxyethyl)-2-hydroxy-6,10,14-trimethyl-pentadecan enthält.
4. Kosmetisches Hautpflegemittel in Emulsionsform gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß es neben üblichen Grund- und Hilfsstoffen eine Kombination aus  
30 0,3 bis 10 % (Gew.-%) eines oder mehrerer UV-Filterstoffe,  
0,3 bis 8 % (Gew.-%) Vitamin-E-linoleat und/oder Vitamin-E-acetat und  
0,3 bis 5 % (Gew.-%) 2-(Dihydroxyethyl)-2-hydroxy-6,10,14-trimethyl-pentadecan enthält.
5. Kosmetisches Hautpflegemittel gemäß den Ansprüchen 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß es  
35 zusätzlich UV-Filter enthält.
6. Kosmetisches Hautpflegemittel gemäß den Ansprüchen 1 bis 4 oder 5, dadurch gekennzeichnet, daß es sich um Öl-in-Wasser- oder Wasser-in-Öl-Emulsionen in Milch- oder Creme-Form handelt.
- 40 7. Kosmetisches Hautpflegemittel gemäß den Ansprüchen 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß es 0,5 bis 10 % (Gew.-%) eines oder mehrerer UV-Filterstoffe, 0,1 bis 10 % (Gew.-%) Vitamin-E-acetat und/oder - linoleat sowie 0,1 bis 5 % 2-(Dihydroxyethyl)-2-hydroxy-6,10,14-trimethyl-pentadecan enthält.
- 45 8. Kosmetisches Hautpflegemittel gemäß der Ansprüche 1 bis 7, dadurch gekennzeichnet, daß es als Grund- oder Hilfsstoffe einen oder mehrere der folgenden Stoffe enthält:  
Antioxidantien, Lösungsmittel, mineralische, tierische oder pflanzliche Öle oder Wachse, Fettsäuren, Fettalkohole, Fettsäureester, Fettalkoholether, ethoxylierte Fettalkohole, Lanolin oder Lanolinderivate, Silikonöle, Emulgatoren, Verdickungsmittel, Feuchthaltemittel, Farbstoffe, Puffersubstanzen, Konservierungsmittel und Parfümöle.
- 50 9. Verfahren zur Herstellung von kosmetischen Hautpflegemitteln gemäß der Ansprüche 1 bis 8, dadurch gekennzeichnet, daß die in Anspruch 7 genannten Wirkstoffe mit den üblichen Grund- und Hilfsstoffen gegebenenfalls unter Vordispersieren, Rühren und/oder Homogenisieren, gegebenenfalls in einer evakuierten Apparatur vermischt werden.
- 55 10. Verwendung von 2-(Dihydroxy-ethyl)-2-hydroxy-6,10,14-trimethyl-pentadecan zur Erhöhung der Penetration und/oder Diffusion von Vitamin-E bzw. seiner Derivate in die bzw. der Haut.



Europäisches  
Patentamt

# EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung

EP 93 11 0701

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl.5)
Y	EP-A-0 343 444 (BAYER) * Seite 2, Zeile 32 - Seite 3, Zeile 39; Ansprüche 1-5; Beispiele 1,4 *	1-10	A61K7/42
Y	US-A-5 102 654 (CASTROGIOVANNI ET AL.) * Ansprüche 1,2; Beispiel 6 *	1-10	
			RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int. Cl.5)
			A61K
Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt			
Recherchant DEN HAAG		Abschlußdatum der Recherche 15 OKTOBER 1993	Prüfer WILLEKENS
KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTE			
X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : mündliche Offenbarung P : Zwischenliteratur		T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze E : älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus anderen Gründen angeführtes Dokument Δ : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument	